

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2001年7月26日 (26.07.2001)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 01/53305 A1(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07F 9/568, C07D  
513/04, 519/00, A61K 31/429, A61P 31/04

(21) 国際出願番号: PCT/JP01/00439

(22) 国際出願日: 2001年1月24日 (24.01.2001)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2000-15105 2000年1月24日 (24.01.2000) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 明治製菓株式会社 (MEIJI SEIKA KAISHA, LTD.) [JP/JP]; 〒104-8002 東京都中央区京橋二丁目4番16号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 佐々木鋭郎

(SASAKI, Toshiro) [JP/JP]. 安藤 孝 (ANDO, Takashi) [JP/JP]. 渡美國夫 (ATSUMI, Kunio) [JP/JP]; 〒222-8567 神奈川県横浜市港北区師岡町760番地 明治製菓株式会社 薬品総合研究所内 Kanagawa (JP).

(74) 代理人: 吉武賢次, 外 (YOSHITAKE, Kenji et al.); 〒100-0005 東京都千代田区丸の内三丁目2番3号 富士ビル323号 協和特許法律事務所 Tokyo (JP).

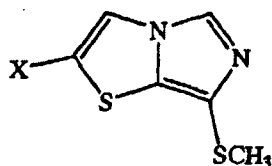
(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM,

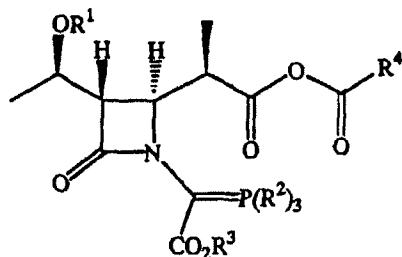
[続葉有])

(54) Title: PROCESSES FOR THE PREPARATION OF CARBAPENEM DERIVATIVES

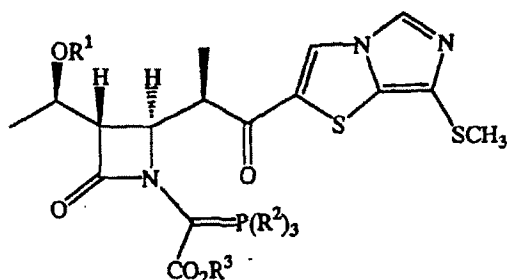
(54) 発明の名称: カルバペネム誘導体の製造法



(I)



(II)



(III)

(57) Abstract: The invention provides processes for preparing carbapenem derivatives having substituted imidazo[5,1-b]thiazolyl groups at the 2-position of carbapenem ring efficiently in safety at a low cost, and intermediates to be used in the processes. Specifically, a process for the preparation of compounds of the general formula (III), which comprises reacting a reaction mixture obtained by treating a compound of the general formula (I) with a Grignard reagent with a compound of the general formula (II) wherein X is halogeno; R<sup>1</sup> is H or a hydroxyl-protecting group; R<sup>2</sup> is optionally substituted alkyl or optionally substituted aryl; R<sup>3</sup> is a carboxyl-protecting group or a group hydrolyzable *in vivo*; and R<sup>4</sup> is optionally substituted alkyl or optionally substituted phenyl.

[続葉有])